

(19) Országkód:

HU



**MAGYAR
KÖZTÁRSASÁG
ORSZÁGOS
TALÁLMÁNYI
HIVATAL**

SZABADALMI LEÍRÁS

(11) Lajstromszám:

210 817 A9

(21) A kérelem ügyszám: P/P 00093

(22) A bejelentés napja: 1995. 03. 29.

(30) Elsőbbségi adatok:

335 888/911991. 11. 27. JP

215 613/921992. 07. 21. JP

Prinzipies

Az alapul szolgáló szabadalom

száma: 651 505 országkódja: AU

Az eredeti oltalom kezdete: 1992. 11. 25.

(51) Int. Cl.⁶

C 07 D 477/00

A 61 K 31/40

(72) Feltalálók:

Nakagawa, Susumu, Ibaraki (JP)

Murase, Satoshi, Ibaraki (JP)

Fukatsu, Hiroshi, Ibaraki (JP)

Kato, Shinji, Ibaraki (JP)

Okamoto, Osamu, Ibaraki (JP)

Mitomo, Ryuji, Ibaraki (JP)

Yamada, Koji, Ibaraki (JP)

Yamamoto, Katsumi, Ibaraki (JP)

(73) Szabadalmaz:

Banyu Pharmaceutical Co. Ltd., Tokió (JP)

(74) Képviselő:

ADVOPATENT Szabadalmi Iroda, Budapest

(54)

Aminoalkil-pirrolidinil-tiokarbapeném-származékok

Az átmeneti oltalom az 1–12. és 15–18. igénypontokra vonatkozik.

használnuk. Ily módon 1,070 g (85,2%) cím szerinti vegyületet kapunk.

NMR (CDCl₃) δ: 2,23–2,74 (3H, m); 3,06 (3H, s); 3,80 (3H, s); 4,12 (1H, m); 4,64 (1H, m); 5,32 (1H, m); 8,27 (1H, s).

60. referenciapélda

(2S,4R)-4-(*tert*-Butil-dimetil-sziloxi)-N-formil-prolin-metil-észter [(275) képletű vegyület]

3,46 g (20,0 mmol) (2S,4R)-1-formil-4-hidroxi-prolin-metil-észter 10 ml N,N-dimetil-formamiddal és 20 ml metilén-dikloriddal készült oldathoz nitrogénatmoszférában, jeges hűtés és keverés közben 3,20 g (21,2 mmol) (*tert*-butil)-klór-dimetil-szilánt és 1,47 g (21,6 mmol) imidazolt adunk. Az elegyet szobahőmérsékleten 4 órán át keverjük, majd vízzel mossuk, vízmentes nátrium-szulfáton szárítjuk, és vákuumban bepároljuk. A maradékot szilikagél (Wakogel™ C-300) oszlopon kromatografáljuk, eluálószerként heptán és etil-acetát 1:1 térfogatarányú elegyét használjuk. Ily módon 5,54 g (96,3%) cím szerinti vegyületet kapunk. NMR (CDCl₃) δ: 0,06 (6H, s); 0,85 (9H, s); 2,03–2,26 (2H, m); 3,43–3,76 (5H, m); 4,42–4,59 (2H, m); 8,23 (1H, s).

SZABADALMI IGÉNYPONTOK

1. (I) általános képletű vegyületek, a képletben

R¹ hidrogénatom vagy metilcsoport,

R² hidrogénatom vagy negatív töltés,

R³ hidrogénatom, halogénatom, hidroxilcsoport, kevés szénatomos alkoxicssoport, kevés szénatomos alkanol-oxi-csoport, aminocsoport, N-(keves szénatomos)alkil-amino-csoport, N,N-di(keves szénatomos)alkil-amino-csoport, kevés szénatomos alkanol-amino-csoport, aroil-amino-csoport, kevés szénatomos alkil-szulfonil-amino-csoport, szulfamoiil-amino-csoport, cianocsoport, nitrocsoport; -COOR⁴ általános képletű csoport, amelyben R⁴ hidrogénatom vagy kevés szénatomos alkilcsoport, vagy

-CONR⁵R⁶ általános képletű csoport, amelyben R⁵ és R⁶ azonos vagy különböző, és hidrogénatom vagy kevés szénatomos alkilcsoport, vagy R⁵ és R⁶ a közbezárt nitrogénatommal együtt heterogén csoporthoz tartoznak, így aziridinil-, azetidínil-, piperidinil-, piperazinil-, 4-(keves szénatomos)alkil-piperazinil- vagy morfolinilcsoportot képez;

A egyenes vagy elágazó szénláncú kevés szénatomos alkilcsoport;

X -NR⁷R⁸ általános képletű csoport, amelyben R⁷ és R⁸ azonos vagy különböző, és hidrogénatomot vagy kevés szénatomos alkilcsoportot jelent, vagy -N⁺R⁹R¹⁰R¹¹ általános képletű csoport, amelyben R⁹, R¹⁰, R¹¹ azonos vagy különböző, és kevés szénatomos alkilcsoportot jelent,

azzal a megkötéssel, hogy amikor A egyenesláncú ke-

vés szénatomos alkilcsoport, R³ jelentése hidrogénatomtól eltérő, vagy gyógyászatilag elfogadható sóik vagy észterek.

2. Az 1. igénypont szerinti, (I-a) általános képletű vegyületek, a képletben

R¹ hidrogénatom vagy metilcsoport;

R² hidrogénatom vagy negatív töltés;

R^{3a} hidrogénatom, halogénatom, hidroxilcsoport, kevés szénatomos alkoxicssoport, kevés szénatomos alkanol-oxi-csoport, aminocsoport, N-(keves szénatomos)alkil-amino-csoport, kevés szénatomos alkanol-amino-csoport, kevés szénatomos alkil-szulfonil-amino-csoport, cianocsoport vagy karbamoilcsoport; A egyenes vagy elágazó szénláncú kevés szénatomos alkilcsoport;

X -NR⁷R⁸ általános képletű csoport, amelyben R⁷ és R⁸ azonos vagy különböző, és hidrogénatom vagy kevés szénatomos alkilcsoport, vagy -N⁺R⁹R¹⁰R¹¹ általános képletű csoport, amelyben R⁹, R¹⁰ és R¹¹ azonos vagy különböző, és kevés szénatomos alkilcsoportot jelent,

azzal a megkötéssel, hogy amikor A egyenesláncú kevés szénatomos alkilcsoport, R^{3a} jelentése hidrogénatomtól eltérő, vagy gyógyászatilag elfogadható sóik vagy észterek.

3. Az 1. igénypont szerinti, (I-b) általános képletű vegyületek, a képletben

R¹ hidrogénatom vagy metilcsoport;

R² hidrogénatom vagy negatív töltés;

R^{3b} hidrogénatom, hidroxilcsoport, aminocsoport, kevés szénatomos alkanol-amino-csoport, kevés szénatomos alkil-szulfonil-amino-csoport, cianocsoport vagy karbamoilcsoport;

A egyenes vagy elágazó szénláncú kevés szénatomos alkilcsoport;

X -NR⁷R⁸ általános képletű csoport, amelyben R⁷ és R⁸ azonos vagy különböző, és hidrogénatom vagy kevés szénatomos alkilcsoport vagy -N⁺R⁹R¹⁰R¹¹ általános képletű csoport, amelyben R⁹, R¹⁰ és R¹¹ azonos vagy különböző, és kevés szénatomos alkilcsoportot jelent,

azzal a megkötéssel, hogy ha A egyenesláncú kevés szénatomos alkilcsoport, R^{3b} hidrogénatomtól eltérő, vagy gyógyászatilag elfogadható sóik vagy észterek.

4. Az 1. igénypont szerinti, (I-c) általános képletű vegyületek, a képletben

R¹ hidrogénatom vagy metilcsoport;

R² hidrogénatom vagy negatív töltés;

R^{3c} halogénatom, kevés szénatomos alkoxicssoport, N-(keves szénatomos)alkil-amino-csoport vagy kevés szénatomos alkanol-oxi-csoport;

A egyenes vagy elágazó szénláncú kevés szénatomos alkilcsoport;

X -NR⁷R⁸ általános képletű csoport, amelyben R⁷ és R⁸ azonos vagy különböző, és hidrogénatom vagy kevés szénatomos alkilcsoport, vagy -N⁺R⁹R¹⁰R¹¹ általános képletű csoport, amelyben R⁹, R¹⁰ és R¹¹ azonos vagy különböző, és kevés szénatomos alkilcsoportot jelent,

60 azzal a megkötéssel, hogy ha A egyenesláncú kevés

szénatomos alkilénecsopót, R^{3c} hidrogénatomtól eltérő; vagy gyógyászatiilag elfogadható sóik vagy észterek.

5. Az 1. igénypont szerinti olyan vegyületek, amelyekben A elágazó szénláncú kevés szénatomos alkilénecsopót.

6. Az 1. igénypont szerinti olyan vegyületek, amelyekben R³ hidroxilcsopót.

7. Az 1. igénypont szerinti olyan vegyületek, amelyekben A elágazó szénláncú kevés szénatomos alkilénecsopót és R³ hidrogénatom, hidroxilcsopót vagy karbamoilcsopót.

8. Az 1. igénypont szerinti olyan vegyületek, amelyekben A egyenesláncú kevés szénatomos alkilénecsopót, és R³ halogénatom, hidroxilcsopót, kevés szénatomos alkoxilcsopót, kevés szénatomos alkanoil-oxilcsopót, aminocsopót, kevés szénatomos alkanoil-amino-csoport, cianocsopót vagy karbamoilcsopót.

9. Az 1. igénypont szerinti olyan vegyületek, amelyek szterikus konfigurációja (5R,6S,8R) vagy (1R,5S,6S,8R).

10. Az olyan 1. igénypont szerinti vegyületek, amelyekben R¹ metilcsopót.

11. Az 1. igénypont szerinti vegyületek közül az alábbiak:

(5R,6S)-2-[(2S,4S)-2-[1-(amino-metil)-2-karbamoil-etil]-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,

(1R,5S,6S)-2-[(2S,4S)-2-[1-(amino-metil)-2-karbamoil-etil]-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-metil-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,

(5R,6S)-2-[(2R,4S)-2-(2-amino-2-karbamoil-etil)-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,

(1R,5S,6S)-2-[(2R,4S)-2-(2-amino-2-karbamoil-etil)-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-metil-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,

(5R,6S)-2-[(2S,4S)-2-(1-acetamido-2-amino-etil)-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,

(1R,5S,6S)-2-[(2S,4S)-2-(1-acetamido-2-amino-etil)-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-metil-karbapen-2-em-3-karbonsav,

(5R,6S)-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-2-[(2S,4S)-2-[1-(metánszulfonil-amido)-2-amino-etil]-pirrolidin-4-il-tio]-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,

(1R,5S,6S)-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-metil-2-[(2S,4S)-2-[1-(metánszulfonil-amido)-2-amino-etil]-pirrolidin-4-il-tio]-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,

(5R,6S)-2-[(2S,4S)-2-(1-amino-1-ciano-metil)-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,

(1R,5S,6S)-2-[(2S,4S)-2-(1-amino-1-ciano-metil)-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-metil-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,

(5R,6S)-2-[(2R,4S)-2-(3-amino-2-metil-propil)-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,

(1R,5S,6S)-2-[(2R,4S)-2-(3-amino-2-metil-propil)-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-metil-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,

(5R,6S)-2-[(2S,4S)-2-(3-amino-1-hidroxi-propil)-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,

(1R,5S,6S)-2-[(2S,4S)-2-(3-amino-1-hidroxi-propil)-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-metil-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,

(5R,6S)-2-[(2S,4S)-2-(1,3-diamino-propil)-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,

(1R,5S,6S)-2-[(2S,4S)-2-(1,3-diamino-propil)-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-metil-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,

(5R,6S)-2-[(2S,4S)-2-(2-amino-1-hidroxi-etil)-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,

(1R,5S,6S)-2-[(2S,4S)-2-(2-amino-1-hidroxi-etil)-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-metil-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,

(5R,6S)-2-[(2R,4S)-2-(3-amino-2,2-dimetil-propil)-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,

(1R,5S,6S)-2-[(2R,4S)-2-(3-amino-2,2-dimetil-propil)-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-metil-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,

(5R,6S)-2-[(2R,4S)-2-[2,2-dimetil-3-(metil-amino)-propil]-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,

(1R,5S,6S)-2-[(2R,4S)-2-[2,2-dimetil-3-(metil-amino)-propil]-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-metil-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,

(5R,6S)-2-[(2S,4S)-2-[1-(amino-metil)-3-hidroxi-propil]-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,

(1R,5S,6S)-2-[(2S,4S)-2-[1-(amino-metil)-3-hidroxi-propil]-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-metil-karbapen-2-em-3-karbonsav,

(5R,6S)-2-[(2S,4S)-2-[(1R)-1-metoxi-3-(N-metil-amino)-propil]-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,

(1R,5S,6S)-2-[(2S,4S)-2-[(1R)-1-metoxi-3-(N-metil-amino)-propil]-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-metil-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,

(5R,6S)-2-[(2S,4S)-2-[(1S)-1-hidroxi-3-(N-metil-amino)-propil]-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,

(1R,5S,6S)-2-[(2S,4S)-2-[(1S)-1-hidroxi-3-(N-metil-amino)-propil]-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-metil-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,

(5R,6S)-2-[(2S,4S)-2-[(1R)-1-hidroxi-3-(N-metil-amino)-propil]-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,

(1R,5S,6S)-2-[(2S,4S)-2-[(1R)-1-hidroxi-3-(N-metil-amino)-propil]-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-metil-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,

(5R,6S)-2-[(2S,4S)-2-[(1S)-1-hidroxi-2-(N-metil-amino)-etil]-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,

(1R,5S,6S)-2-[(2S,4S)-2-[(1S)-1-hidroxi-2-(N-metil-amino)-etil]-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-metil-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,

(5R,6S)-2-[(2S,4S)-2-[(1R)-1-hidroxi-2-(N-metil-amino)-etil]-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,

(5R,6S)-2-[(2S,4S)-2-[(1R)-1-hidroxi-2-(N-metil-amino)-etil]-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,
 (1R,5S,6S)-2-[(2S,4S)-2-[(1R)-1-hidroxi-2-(N-metil-amino)-etil]-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-metil-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,
 (5R,6S)-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-2-[(2R,4S)-2-[(N-metil-amino)-propil]-pirrolidin-4-il-tio]-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,
 (1R,5S,6S)-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-2-[(2R,4S)-2-[(N-metil-amino)-propil]-pirrolidin-4-il-tio]-1-metil-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,
 (5R,6S)-2-[(2R,4S)-2-[(N-metil-amino)-propil]-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,
 (1R,5S,6S)-2-(2R,4S)-2-[(3-hidroxi-2-(N-metil-amino)-propil]-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,
 (1R,5S,6S)-2-(2R,4S)-2-[(3-hidroxi-2-(N-metil-amino)-propil]-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-metil-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,
 (5R,6S)-2-[(2R,4S)-2-(2-amino-2-metil-propil)-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,
 (1R,5S,6S)-2-[(2R,4S)-2-(2-amino-2-metil-propil)-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-metil-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,
 (5R,6S)-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-2-[(2R,4S)-2-[(2-metil-2-(N-metil-amino)-propil]-pirrolidin-4-il-tio]-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,
 (1R,5S,6S)-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-metil-2-[(2R,4S)-2-[(2-metil-2-(N-metil-amino)-propil]-pirrolidin-4-il-tio]-1-metil-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,
 (5R,6S)-2-[(2R,4S)-2-(3-amino-3-metil-butil)-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,
 (1R,5S,6S)-2-[(2R,4S)-2-(3-amino-3-metil-butil)-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-metil-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,
 (5R,6S)-2-[(2S,4S)-2-[1-(amino-metil)-3-hidroxi-propil]-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,
 (1R,5S,6S)-2-[(2S,4S)-2-[1-(amino-metil)-3-hidroxi-propil]-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-metil-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,
 (5R,6S)-2-[(2S,4S)-2-[1-(2-amino-etil)-3-hidroxi-propil]-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,
 (1R,5S,6S)-2-[(2S,4S)-2-[1-(2-amino-etil)-3-hidroxi-propil]-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-metil-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,
 (5R,6S)-2-[(2R,4S)-2-(3-amino-2-hidroxi-propil)-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,
 (1R,5S,6S)-2-[(2R,4S)-2-(3-amino-2-hidroxi-propil)-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-metil-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,
 (5R,6S)-2-[(2R,4S)-2-(2-acetoxi-3-amino-propil)-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,
 (1R,5S,6S)-2-[(2R,4S)-2-(2-acetoxi-3-amino-propil)-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-metil-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,

(5R,6S)-2-[(2R,4S)-2-(2-amino-propil)-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,
 (1R,5S,6S)-2-[(2R,4S)-2-(2-amino-propil)-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-metil-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,
 (5R,6S)-2-[(2R,4S)-2-[3-(N-metil-amino)-propil]-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,
 (1R,5S,6S)-2-[(2R,4S)-2-[3-(N-metil-amino)-propil]-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-metil-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,
 (5R,6S)-2-[(2R,4S)-2-[2-fluor-3-(N-metil-amino)-propil]-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,
 (1R,5S,6S)-2-[(2R,4S)-2-[2-fluor-3-(N-metil-amino)-propil]-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-metil-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,
 (5R,6S)-2-[(2R,4S)-2-[1-metil-3-(N-metil-amino)-propil]-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,
 (1R,5S,6S)-2-[(2R,4S)-2-[1-metil-3-(N-metil-amino)-propil]-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-metil-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,
 (5R,6S)-2-[(2R,4S)-2-[1-(amino-metil)-etil]-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,
 (1R,5S,6S)-2-[(2R,4S)-2-[1-(amino-metil)-etil]-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-metil-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,
 (5R,6S)-2-[(2S,4S)-2-[(1R)-3-(N,N-dimetil-amino)-1-hidroxi-propil]-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,
 (1R,5S,6S)-2-[(2S,4S)-2-[(1R)-3-(N,N-dimetil-amino)-1-hidroxi-propil]-pirrolidin-4-il-tio]-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-metil-1-karbapen-2-em-3-karbonsav,
 12. Az 1. igénypont szerinti (1R,5S,6S)-2-(2S,4S)-2-[(1R)-1-hidroxi-3-(N-metil-amino)-propil]-pirrolidin-4-il-tio-6-[(1R)-1-hidroxi-etil]-1-metil-1-karbapen-2-em-3-karbonsav.
 13. (2S,4S)-4-Merkapto-2-[(1R)-1-hidroxi-3-(N-metil-amino)-propil]-pirrolidin.
 14. Eljárás (I) általános képletű vegyületek, a képletben
 45 R¹ hidrogénatom vagy metilcsoport,
 R² hidrogénatom vagy negatív töltés,
 R³ hidrogénatom, halogénatom, hidroxilcsoport, kevés szénatomos alkoxycsoport, kevés szénatomos alkanol-oxi-csoport, aminocsoport, N-(kevésszénatomos)alkil-amino-csoport, N,N-di(kevésszénatomos)alkil-amino-csoport, kevés szénatomos alkanol-amino-csoport, aroil-amino-csoport, kevés szénatomos alkil-szulfonil-amino-csoport, szulfamoid-amino-csoport, cianocsoport, nitrocsoport,
 50 -COOR⁴ általános képletű csoport, amelyben
 55 R⁴ hidrogénatom vagy kevés szénatomos alkilcsoport, vagy
 -CONR⁵R⁶ általános képletű csoport, amelyben
 R⁵ és R⁶ azonos vagy különböző, és hidrogénatom vagy kevés szénatomos alkilcsoport, vagy
 60

73

- CONR³R⁶ általános képletű csoport, amelyben R³ és R⁶ azonos vagy különböző, és hidrogénatom vagy kevés szénatomos alkilcsoport, vagy R³ és R⁶ a közbezárt nitrogénatommal együtt heterogyrús csoportot, így aziridinil-, azetidínil-, pirrolidinil-, piperidinil-, piperazinil-, 4-(keves szénatomos)alkilpiperazinil- vagy morfolinilcsoportot képez.
- A egyenes vagy elágazó szénláncú kevés szénatomos alkilcsoport;
- X —NR⁷R⁸ általános képletű csoport, amelyben R⁷ és R⁸ azonos vagy különböző, és hidrogénatomot vagy kevés szénatomos alkilcsoportot jelent, vagy —N⁺R⁹R¹⁰R¹¹ általános képletű csoport, amelyben R⁹, R¹⁰, R¹¹ azonos vagy különböző, és kevés szénatomos alkilcsoportot jelent,
- 5 azzal a megkötéssel, hogy amikor A egyenesláncú kevés szénatomos alkilcsoport, R³ jelentése hidrogénatomtól eltérő, vagy gyógyászati lag elfogadható sói vagy észterei antibakteriálisan hatásos mennyiségét beadjuk.
20. A 19. igénypont szerinti eljárás, *azzal jellemezve*, hogy a vegyületet pseudomonasok ellen használjuk.
21. A 19. igénypont szerinti eljárás, *azzal jellemezve*, hogy a vegyületet meticillinre rezisztens *Staphylococcus aureus* fajok ellen használjuk.
22. A 19. igénypont szerinti eljárás, *azzal jellemezve*, hogy az ilyen kezelést igénylő egyénnek a 11. igénypont szerinti vegyület antibakteriálisan hatásos mennyiségét beadjuk.
- 10
- 15

